## 特許協力条約

PCT

## REC'D 1 1 AUG 2005

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第 12 条、法施行規則第 56 条) [PCT36 条及びPCT規則 70]

出願人又は代理人 の告類記号 P652	今後の手続きについては、様式P(	いては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。			
国際出願番号 PCT/JP2004/012398	国際出願日 (日.月.年) 27.08.200	優先日 (日.月.年) 28.08.200	3		
国際特許分類(IPC)Int.Cl. C07D403/04, A61K31/404, A61P1/00, 1/14, 3/00, 7/02, 9/00, 9/12, 17/14, 25/08, 25/14, 25/16, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 29/00, 37/02, 43/00, C07M7/00					
出願人 (氏名又は名称) 大正製薬株式会社					
1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条(PCT36条)の規定に従い送付する。					
2. この国際予備審査報告は、この表紙を	と含めて全部で3	ページからなる。			
3. この報告には次の附属物件も添付されている。					
a. 「 附属書類は全部で	<b></b> ページである。				
「 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範 囲及び/又は図面の用紙(PCT規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)					
第1欄4.及び補充欄に示	したように、出願時における国際出	, 顔の開示の範囲を超えた補正を含むものと	この		
国際予備審査機関が認定した	た差替え用紙				
b. 「 電子媒体は全部で (第子媒体の種類 数を示す)					
		, (電子媒体の種類、数を示す	<del> </del>		
配列表に関する補充欄に示す。	ように、コンピュータ読み取り可能な 2 号参照)	(電子媒体の種類、数を示す ・形式による配列表又は配列表に関連する	ナ)。 5テー		
配列表に関する補充欄に示す』 ブルを含む。(実施細則第 802	2 方参照)	(電子媒体の種類、数を示す ほ形式による配列表又は配列表に関連する	<b>計)。</b> 5テー		
配列表に関する補充欄に示す。	2 方参照)	・ (電子媒体の種類、数を示す ・形式による配列表又は配列表に関連する ・	<b>計)。</b> 5テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「デ 第 I 棚 国際予備審査報	で で で 成 グロー・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・	・ (電子媒体の種類、数を示す ・形式による配列表又は配列表に関連する	ナ)。 5テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を デ 第 I 欄 国際予備審査報 第 I 欄 優先権 第 I 欄 新規性、進歩性	と 方を思り と含む。 设告の基礎 E又は産業上の利用可能性についての		<b>計)。</b> 5テー		
配列表に関する補充欄に示す。 プルを含む。(実施細則第 802 4.この国際予備審査報告は、次の内容を 「第 I 棚 国際予備審査報 「第 I 棚 優先権 「第 I 棚 新規性、進歩性 「第 I 棚 発明の単一性の	でででは、 で含む。 受告の基礎 を又は産業上の利用可能性についての での欠如	<ul><li>・形式による配列表又は配列表に関連する</li><li>・国際予備審査報告の不作成</li></ul>	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 プルを含む。(実施細則第 802 4.この国際予備審査報告は、次の内容を 「第 I 欄 国際予備審査報 「第 I 欄 優先権 「第 II 欄 優先権 「第 II 欄 発明の単一性の 「第 IV欄 発明の単一性の 「第 V欄 P C T 35条(2)」	2 方 (を成)		テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「第 I 棚 国際予備審査報 「第 II 棚 優先権 「第 II 棚 新規性、進歩性 「第 IV棚 発明の単一性の 「第 V 棚 P C T 35条 (2) に けるための文献 「第 Y I棚 ある種の引用文	2 方を限り と含む。 最告の基礎 E又は産業上の利用可能性についての の欠如 に規定する新規性、進歩性又は産業 及び説明	<ul><li>・形式による配列表又は配列表に関連する</li><li>・国際予備審査報告の不作成</li></ul>	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 プルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 第 I 欄 国際予備審査報 第 II 欄 優先権 第 II 欄 発明の単一性の 「第 V欄 P C T 35条(2)ト けるための文献 「第 VI欄 ある種の引用文 第 VI欄 国際出願の不備	を 方を照り と含む。 最佳の基礎 を又は産業上の利用可能性についての の欠如 に規定する新規性、進歩性又は産業 及び説明 に献	<ul><li>・形式による配列表又は配列表に関連する</li><li>・国際予備審査報告の不作成</li></ul>	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「第 I 棚 国際予備審査報 「第 II 棚 優先権 「第 II 棚 新規性、進歩性 「第 IV棚 発明の単一性の 「第 V 棚 P C T 35条 (2) に けるための文献 「第 Y I棚 ある種の引用文	を 方を照り と含む。 最佳の基礎 を又は産業上の利用可能性についての の欠如 に規定する新規性、進歩性又は産業 及び説明 に献	<ul><li>・形式による配列表又は配列表に関連する</li><li>・国際予備審査報告の不作成</li></ul>	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「第 I 棚 国際予備審査報 「第 I 棚 優先権 「第 I 棚 優先権 「第 I 棚 優先権 「第 I 棚 優先権 「第 I V 棚 新規性、進歩性 「第 V 棚 P C T 35条(2) にけるための文献 けるための文献 ある種の引用文備 第 V 棚 国際出願の不備 第 V 棚 国際出願に対す	を含む。  会告の基礎  に又は産業上の利用可能性についての の欠如  に規定する新規性、進歩性又は産業  及び説明  「献	は形式による配列表又は配列表に関連する 国際予備審査報告の不作成 上の利用可能性についての見解、それを裏	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 プルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 第 I 欄 国際予備審査報 第 II 欄 優先権 第 II 欄 発明の単一性の 「第 V欄 P C T 35条(2)ト けるための文献 「第 VI欄 ある種の引用文 第 VI欄 国際出願の不備	と 字 を 限 )	<ul><li>・形式による配列表又は配列表に関連する</li><li>・国際予備審査報告の不作成</li></ul>	テー		
配列表に関する補充欄に示す。プルを含む。(実施細則第 802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 第 I 欄 国際予備審査報	で含む。 を含む。 をとれての をとれての をとれての をとれての をとれていての をとれていての をとれていての をは、他を性又は産業 では、 では、 では、 では、 では、 では、 では、 では、	全形式による配列表又は配列表に関連する 国際予備審査報告の不作成 上の利用可能性についての見解、それを裏 との利用可能性についての見解、それを裏 とのものでは、というでは、これを裏	付		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「第1欄 国際予備審査報 「第1欄 優先権 「第1個 優先権 「第1V欄 新規性、進歩性 第V欄 PCT355条(2)に けるるための引用文 第V間 国際出願の不備 第V間 国際出願に対す	と含む。 最告の基礎 E又は産業上の利用可能性についての の欠如 に規定する新規性、進歩性又は産業 及び説明 「高・ 一る意見  国際予備審査 を 2  特許庁審査官	本形式による配列表又は配列表に関連する 国際予備審査報告の不作成 上の利用可能性についての見解、それを裏 股告を作成した日 6.07.2005 (権限のある職員) 4C 32	テー		
配列表に関する補充欄に示す。 ブルを含む。(実施細則第802 4. この国際予備審査報告は、次の内容を 「第1欄 国際予備審査報告は、次の内容を 第1欄 優先権 第1個 優先権 第1V欄 新規性、進歩性 第1V欄 PCT35条(2) にけるための引 第V間 PCT35条(2) にけるための引 第V間 国際出願の不対 第V間 国際出願に対す	で含む。 日本の基礎 に又は産業上の利用可能性についての の欠如 に規定する新規性、進歩性又は産業 に及び説明 に対 こま こま こま こま こま こま こま こま こま 、	全形式による配列表又は配列表に関連する 国際予備審査報告の不作成 上の利用可能性についての見解、それを裏 との利用可能性についての見解、それを裏 とのものでは、というでは、これを裏	付		

第I概	報告の基礎				
1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の督語を基礎とした。					
この報告は、					
2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)					
, F	出願時の国際出願書類				
, <b>「</b>	明細書  第				
<b>r</b>	請求の範囲  第				
r	第       項*、       付けで国際予備審査機関が受理したもの         図面       第       ページ/図、出願時に提出されたもの         第       ページ/図*、       付けで国際予備審査機関が受理したもの         第       ページ/図*、       付けで国際予備審査機関が受理したもの				
配列表又は関連するテーブル 配列表に関する補充欄を参照すること。					
3. 「補正により、下記の書類が削除された。					
	明細曹       第       ページ         請求の範囲       第       項         図面       第       ページ/図         配列表(具体的に記載すること)          配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)				
4. 「 この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。 (PCT規則 70.2(c))					
,	明細書       第       ページ         前求の範囲       第       項         図面       第       ページ/図         配列表(具体的に記載すること)          配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)				
* 4. 1	に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。				

## 特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2004/012398

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第 12 条 (PCT35 条(2)) に定める見解、 それを裏付ける文献及び説明				
1. 見解				
新規性(N)	請求の範囲 <u>1-8</u> 請求の範囲	有 無無		
進歩性(IS)	請求の範囲 <u>1 - 8</u> ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・	· 有 無		
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 <u>1-8</u> 請求の範囲			

## 2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献 1: WO 01/98295 A1 (SANOFI-SYNTHELABO) 2001.12.27

文献 2: JP 2003-523351 A (サノフィーサンテラボ) 2003.08.05 文献 3: JP 2003-525287 A (サノフィーサンテラボ) 2003.08.26

請求の範囲1-8 に係る発明は、国際調査報告に記載された何れの文献にも開示されておらず、新規性及び進歩性を有する。特に、式(1)及び式(2)で表される化合物、及び、1, 3-ジヒドロ-2H-インドール-2-オン誘導体のピロリジンの4位をフッ素原子で置換することにより、化合物の脳内移行性が向上し、血漿中濃度が高まる旨は、最も関連のある先行技術文献であると認められる文献1-3にも開示されていない。